

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
26. Mai 2005 (26.05.2005)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2005/047276 A2

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: C07D 309/30

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/012659

(22) Internationales Anmeldedatum:
9. November 2004 (09.11.2004)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
103 52 659.5 11. November 2003 (11.11.2003) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von
US): RATIOPHARM GMBH [DE/DE]; Graf-Arco-Str.
3, 89079 Ulm (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): TARAROV, Vitali
[RU/RU]; Chertanovskaya Str. 51-3-275, Moskau (RU).
KÖNIG, Gerd [DE/DE]; Am Fuchsgraben 11 F, 08056
Zwickau (DE). BÖRNER, Armin [DE/DE]; Im Winkel
40, 18059 Rostock (DE).

(74) Anwälte: BEST, Michael usw.; Lederer & Keller, Prinzre-
gentenstr. 16, 80538 München (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL,
AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH,
CN, CO, CR, CU, CZ, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI,
GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE,
KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD,
MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG,
PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM,
TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM,
ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW,
GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG,
ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU,
TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK,
EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LU, MC, NL, PL,
PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM,
GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

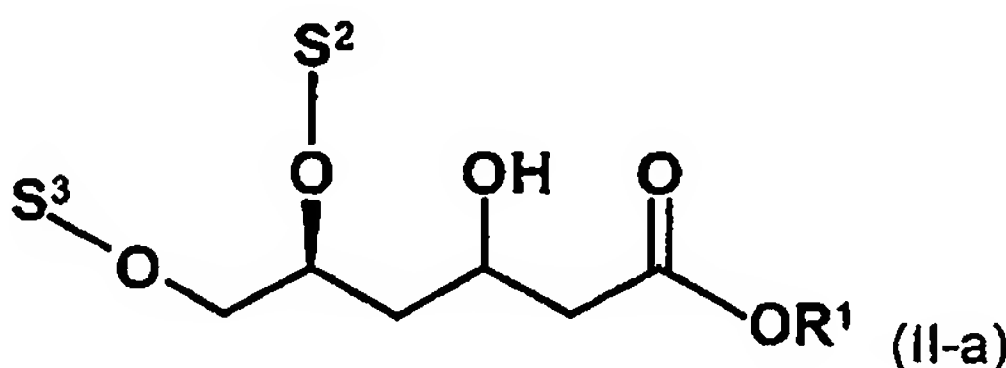
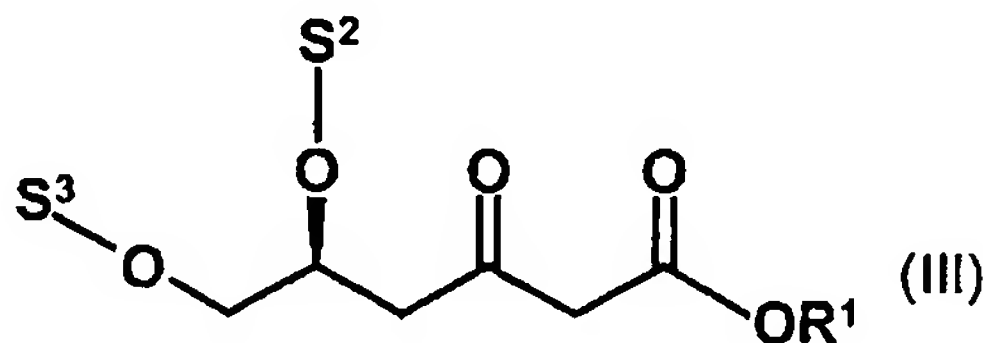
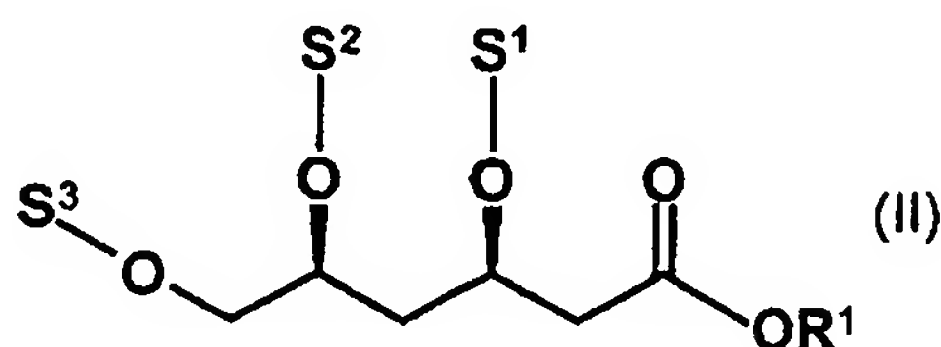
Veröffentlicht:

— ohne internationalen Recherchenbericht und erneut zu ver-
öffentlichen nach Erhalt des Berichts

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: METHOD FOR THE PRODUCTION OF STATINS

(54) Bezeichnung: VERFAHREN ZUR HERSTELLUNG VON STATINEN



(57) Abstract: The invention relates to a method for the production of a statin. Said method comprises the following steps: a) a compound of formula (II) is produced, wherein S¹ represents a hydrogen atom or a hydroxyl protective group, S² and S³ independently represent a hydroxyl protective group and R¹ represents a hydrogen atom or a carboxyl protective group. Said compound of formula (II) is produced by stereoselective hydrogenation of a compound of formula (III) in order to form a compound of formula (II-a) and, optionally, by introducing a hydroxyl protective group. b) by lactonising the compound of formula II in order to form a compound of formula (I-a).

(57) Zusammenfassung: Erfindungsgemäß wird ein Verfahren zur Herstellung eines Statins zur Verfügung gestellt, umfassend die folgenden Schritte: a) Herstellung einer Verbindung der Formel (II), in der S¹ ein Wasserstoffatom oder eine Hydroxylschutzgruppe bedeutet, S² und S³ unabhängig voneinander Hydroxylschutzgruppen bedeuten und R¹ ein Wasserstoffatom oder eine Carboxylschutzgruppe darstellt, durch stereoselektive Hydrierung einer Verbindung der Formel (III) zu einer Verbindung der Formel (II-a) und gegebenenfalls Einführung einer Hydroxylschutzgruppe und b) Lactonisierung der Verbindung der Formel (II) zu einer Verbindung der Formel (I-a).

WO 2005/047276 A2



Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.